



Информация для пациентов об использовании препарата

Финлепсин - Досье препарата
Особенности и преимущества

ИНСТРУКЦИЯ
(для пациентов)
по медицинскому применению препарата **ФИНЛЕПСИН®**

Reg №: П №015012/01-2003

Торговое название

ФИНЛЕПСИН®

Международное непатентованное название

Карбамазепин

Химическое название

5Н-Дибенз[b, f]азепин-5-карбоксамид

Лекарственная форма

Таблетки

Описание

Белые, круглые таблетки, выпуклые с одной стороны; с фаской и риской в виде клинообразного углубления по диаметру таблетки с другой стороны.



Состав

Одна таблетка содержит
200 мг действующего вещества карбамазепина и

вспомогательные вещества:

желатин, стеарат магния, микрокристаллическую целлюлозу, кроскармеллоза-натрий.

Фармакотерапевтическая группа.

Противоэпилептическое средство.

Код АТС. N03AF01

Фармакологическое действие.

Противоэпилептическое средство (производное дибензазепина), оказывающее так же антидепрессивное, антипсихотическое, антиманиакальное и антидиуретическое действие, обладает анальгезирующим действием у больных с невралгией. Механизм действия связан с блокадой потенциал-зависимых натриевых каналов, что приводит к стабилизации мембраны перевозбужденных нейронов, ингибированию возникновения серийных разрядов нейронов и снижению синаптического проведения импульсов. Предотвращает повторное образование Na^+ -зависимых потенциалов действия в деполяризованных нейронах. Снижает высвобождение возбуждающей нейромедиаторной аминокислоты глутамата, повышает сниженный судорожный порог центральной нервной системы и, таким образом, уменьшает риск развития эпилептического приступа. Увеличивает проводимость K^+ , модулирует потенциалзависимые Ca^{2+} каналы, что также может вносить вклад в противосудорожное действие препарата. Эффективен при фокальных (парциальных) эпилептических приступах (простых и комплексных), сопровождающихся или не сопровождающихся вторичной генерализацией, при генерализованных тонико-клонических эпилептических приступах, а также при комбинации указанных типов приступов (обычно неэффективен при малых приступах - petit mal, абсансах и миоклонических приступах). У пациентов с эпилепсией (в особенности у детей и подростков) отмечено положительное влияние на симптомы тревожности и депрессии, а также снижение раздражительности и агрессивности. Влияние на когнитивную функцию и психомоторные показатели зависит от дозы. Начало противосудорожного эффекта варьирует от нескольких часов до нескольких дней (иногда до 1 месяца вследствие аутоиндукции метаболизма). При эссенциальной и вторичной невралгии тройничного нерва в большинстве случаев предупреждает появление болевых приступов. Ослабление болей при невралгии тройничного нерва отмечается через 8 - 72 ч. При синдроме алкогольной абстиненции повышает порог судорожной готовности (который при данном состоянии обычно снижен) и уменьшает выраженность клинических проявлений синдрома (повышенная возбудимость, тремор, нарушения походки). Антипсихотическое (антиманиакальное) действие развивается через 7-10 дней, может быть обусловлено угнетением метаболизма дофамина и норадреналина.

Фармакокинетика:

Абсорбция - медленная, но полная (прием пищи существенно не влияет на скорость и степень всасывания). После однократного приема таблетки максимальная концентрация достигается через 12 ч. Время достижения максимальной концентрации составляет 4-5 ч. Равновесные концентрации препарата в плазме достигаются через 1-2 нед (скорость достижения зависит от индивидуальных особенностей метаболизма:

аутоиндукция ферментных систем печени, гетероиндукция другими, одновременно применяемыми, лекарственными средствами), а также от состояния больного, дозы препарата и длительности лечения. Наблюдаются существенные межиндивидуальные различия значений равновесных концентраций в терапевтическом диапазоне: у большинства больных эти значения колеблются от 4 до 12 мкг/мл (17–50 мкмоль/л). Концентрации карбамазепин–10,11–эпоксида (фармакологически активного метаболита) составляют около 30% от концентрации карбамазепина. Связь с белками плазмы у детей – 55–59%, у взрослых – 70–80%. Кажущийся объем распределения – 0.8–1.9 л/кг. В спинно-мозговой жидкости и слюне создаются концентрации пропорционально количеству несвязанного с белками активного вещества (20–30%). Проникает через плацентарный барьер. Концентрация в грудном молоке составляет 25–60% от таковой в плазме. (Читайте продолжение)

Метаболизируется в печени, преимущественно по эпоксидному пути с образованием главных метаболитов: активного – карбамазепин–10,11–эпоксида и неактивного конъюгата с глюкуроновой кислотой. Основным изоферментом, обеспечивающим биотрансформацию карбамазепина в карбамазепин–10,11–эпоксид, является цитохром P450 (CYP 3A4). В результате этих метаболических реакций образуется также и мало активный метаболит 9–гидрокси–метил–10–карбамоилакридан. Может индуцировать собственный метаболизм. Период полувыведения после приема разовой пероральной дозы составляет 25–65 ч (в среднем около 36 ч), после повторного приема в зависимости от длительности лечения – 12–24 ч (вследствие аутоиндукции монооксигеназной системы печени). У пациентов, получающих дополнительно другие противосудорожные препараты (индукторы монооксигеназной системы – фенитоин, фенобарбитал) период полувыведения составляет в среднем 9–10 ч. После однократного приема карбамазепина внутрь – 72% принятой дозы выводится с мочой и 28% с калом. Около 2% принятой дозы выводятся с мочой в виде неизмененного карбамазепина, около 1% — в виде 10,11–эпоксидного метаболита. У детей, вследствие более быстрой элиминации карбамазепина, может потребоваться применение более высоких доз препарата из расчета на кг массы тела, по сравнению со взрослыми. Нет данных, свидетельствующих о том, что фармакокинетика карбамазепина меняется у пациентов пожилого возраста.

Показания к применению: Эпилепсии: парциальные припадки с простой симптоматикой (фокальные припадки), парциальные припадки со сложной симптоматикой, психомоторные припадки, большие судорожные припадки в основном фокального генеза (большие судорожные припадки во время сна, диффузные большие судорожные припадки), смешанные формы эпилепсии; невралгия тройничного нерва; идиопатическая глоссофарингеальная невралгия; боли при поражениях периферических нервов при сахарном диабете, боли при диабетической нейропатии; эпилептиформные судороги при рассеянном склерозе, спазмы лицевых мышц при невралгии тройничного нерва, тонические судороги, приступообразные нарушения речи и движений (пароксизмальная дизартрия и атаксия), пароксизмальные парестезии и приступы боли; синдром алкогольной абстиненции (тревога, судороги, гипервозбудимость, нарушения сна); психотические расстройства (аффективные и шизоаффективные расстройства, психозы, нарушения функции лимбической системы).

Противопоказания: Нарушения костномозгового кроветворения (анемия, лейкопения), атриовентрикулярная блокада, гиперчувствительность к действующему и вспомогательным веществам, трициклическим антидепрессантам, острая перемежающаяся порфирия (в том числе в анамнезе), одновременно с препаратами лития и ингибиторами МАО.



С осторожностью препарат следует применять: при тяжелой сердечной недостаточности, при недостаточности функций печени и почек, у пациентов пожилого возраста, при активном алкоголизме (усиливается угнетение ЦНС, усиливается метаболизм карбамазепина), гипонатриемия разведения (синдром гиперсекреции АДГ, гипопитуитаризм, гипотиреоз, недостаточность коры надпочечников), гиперплазия предстательной железы, повышение внутриглазного давления, в комбинации с седативно-гипнотическими средствами.

Применение в периоды беременности и лактации.

У женщин репродуктивного возраста карбамазепин должен, по возможности, применяться в виде монотерапии (используя минимально эффективную дозу) - частота врожденных аномалий новорожденных, рожденных женщинами, которым проводилось комбинированное противосудорожное лечение, выше, чем у тех, кто получал каждое из этих средств в виде монотерапии.

При наступлении беременности (при решении вопроса о назначении карбамазепина в период беременности) необходимо тщательно сопоставить ожидаемые преимущества терапии и возможные ее осложнения, особенно в первые 3 месяца беременности. Известно, что дети, рождающиеся у матерей, страдающих эпилепсией, чаще страдают от пороков развития. Карбамазепин способен повышать риск возникновения этих нарушений. Имеются единичные сообщения о случаях врожденных заболеваний и пороков развития, включая незаращение дужек позвонков (spina bifida). Пациенткам должна предоставляться информация о возможности повышения риска развития врожденных пороков.

Карбамазепин усиливает дефицит фолиевой кислоты, часто наблюдающийся во время беременности, что может способствовать увеличению частоты врожденных дефектов у детей (и до и во время беременности рекомендуется дополнительный прием фолиевой кислоты). С целью профилактики геморрагических осложнений у новорожденных, женщинам в последние недели беременности, а также новорожденным рекомендуется назначать витамин К1.

Карбамазепин проникает в грудное молоко, следует сопоставить преимущества и возможные нежелательные последствия грудного вскармливания в условиях продолжающейся терапии. (Читайте продолжение)

Матери, принимающие карбамазепин, могут кормить своих детей грудью при условии, что за ребенком будет установлено наблюдение в отношении развития возможных побочных реакций (например, выраженной сонливости, аллергических кожных реакций).



Способ применения и дозы:

Таблетки для приема внутрь.

Финлепсин может назначаться в качестве основного терапевтического средства и в сочетании с другими противосудорожными препаратами.

Таблетки принимают во время или после еды, запивая достаточным количеством жидкости. Терапевтическая концентрация финлепсина в плазме крови составляет 4 -12 мкг/мл. Общепринятый диапазон доз составляет 400 -1200 мг финлепсина в сутки, которые распределяют на 1 –2 приема в день.

Превышение общей суточной дозы, составляющей 1200 мг, не имеет смысла. Максимальная суточная доза не должна превышать 1600 мг, т.к. более высокие дозы могут способствовать увеличению числа побочных действий.

Если больной забыл своевременно принять очередную дозу препарата, следует принять попущенную дозу сразу, как только это упущение стало замеченным, при этом нельзя принимать двойную дозу препарата.

Противосудорожное лечение

В тех случаях, когда это возможно, карбамазепин следует назначать в виде монотерапии. Лечение начинают с применения небольшой суточной дозы, которую в последующем медленно повышают до достижения оптимального эффекта.

Присоединение карбамазепина к уже проводящейся противоэпилептической терапии следует проводить постепенно, при этом дозы применяемых препаратов не меняют или, при необходимости, корригируют.

У взрослых начальную дозу, составляющую 1 -2 таблетки в день (соответствует 200 -400 мг карбамазепина), медленно повышают до достижения оптимального лечебного эффекта, поддерживающая доза соответствует 4 - 6 таблеток в день (соответствует 800 - 1200 мг карбамазепина).



Поддерживающая доза для детей в среднем составляет 10 - 20 мг/кг массы тела в сутки.

Рекомендуется следующая схема дозирования:

